PCT

WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM

Internationales Būro INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation 4: WO 89/10701 (11) Internationale Veröffentlichungsnummer: **A1** (43) Internationales A23K 1/16 Veröffentlichungsdatum: 16. November 1989 (16.11.89)

PCT/EP89/00477 (21) Internationales Aktenzeichen:

(22) Internationales Anmeldedatum: 29. April 1989 (29.04.89)

(30) Prioritätsdaten:

P 38 15 344.0 5. Mai 1988 (05.05.88)

DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Carl-Bosch-Straße 38, D-6700 Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder ; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): EULER, Klaus [DE/DE]; Maxstraße 65, D-6700 Ludwigshafen (DE). LECHT-KEN, Peter [DE/DE]; Ludwigshafener Straße 6 B, D-6710 Frankenthal (DE). FRANZ, Lothar [DE/DE]; Sternstraße 197, D-6700 Ludwigshafen (DE). HOPPE, Peter, Paul [DE/DE]; Am Hauenstein 13, D-6706 Wachenheim (DE). SCHOENER, Franz-Josef [DE/DE]; Poststraße 26, D-6732 Edenkoben (DE).

(81) Bestimmungsstaaten: AT (europäisches Patent), BE (europäisches Patent), CH (europäisches Patent), DE (europäisches Patent), FR (europäisches Patent), GB (europäisches Patent), IT (europäisches Patent), LU (europäisches Patent), NL (europäisches Patent), SE (europäisches Patent), US.

Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.

(54) Title: SUBSTANCES BASED ON URACIL-DERIVATES FOR STIMULATING GROWTH AND REDUCING FAT IN ANIMALS

(54) Bezeichnung: MITTEL AUF DER BASIS VON URACIL-DERIVATEN ZUR WACHSTUMSFÖRDERUNG UND FETTREDUKTION BEI TIEREN

(57) Abstract

Said substances also improve the assimilation of food and the protein absorption in animals. They contain at least one uracil-derivate or one physiologically tolerated salt thereof.

(57) Zusammenfassung.

Es werden Mittel zur Wachstumsförderung und Fettreduktion sowie zur Steigerung der Futterverwertung und des Proteinansatzes bei Tieren vorgeschlagen, die mindestens ein Uracil-Derivat oder ein physiologisch verträgliches Salz davon enthalten.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Code, die zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AT	Österreich	FI	Finaland	MR	Mauritanies
AU	Australien	FR	Frankreich	MW	Malawi
BB	Barbados	GA	Gabon	NL	Niederlande
BE	Behgien	GB	Vereinigtes Königreich	NO.	Norwegen
BF	Burkina Fasso	HU	Ungarn	RO	Rumānien
BG	Bulgarien	TT.	Italien	SD	Sudan .
BJ	Benin	JР	Japan	SE	Schweden
BR.	Brasilien .		Demokratische Volksrepublik Korea	SN	Senegal *
		KR	Republik Korea	SU	Soviet Union
CF	Zentrale Afrikanische Republik		Liechtenstein	TD	Tschad
CG	Kongo	บ		TG	Togo
CH	Schweiz	LK	Sri Lanka		
CM	Kamerun	w	Luxemburg	us	Vereinigte Staaten von Amerika
DE	Deutschland, Bundesrepublik	MC	Monaco		
DK	Dänemark	MG	Madagaskar		
23	Spanien	MI.	Mali		

WO 89/10701 PCT/EP89/00477

Mittel auf der Basis von Uracil-Derivaten zur Wachstumsförderung und Fettreduktion bei Tieren

Beschreibung

5

Die Erfindung betrifft ein Mittel auf der Basis von Uracil-Derivaten und deren Verwendung zur Wachstumsförderung, Steigerung der Futterverwertung und des Proteinansatzes sowie zur Fettreduktion bei Tieren, insbesondere Nutz- und Haustieren.

10

Die Verwendung von Futtermittelzusätzen zur Erzielung höherer Gewichtszusätze, verbesserter Futterausnutzung und vermindertem Fettansatz wird in der Tierernährung insbesondere bei der Mast von Schweinen, Rindern und Geflügel bereits weitgehend praktiziert.

15

Gefunden wurden nun Mittel, enthaltend mindestens ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel Γ ,

in der A und B entweder für ein Wasserstoffatom stehen oder zusammen eine 20 Bindung bilden,

- D Sauerstoff oder Schwefel, die Gruppe =NCN oder die Gruppe =NE bedeutet, wobei E eine Phenyl-, Benzyl-, Pyridyl, C₁-C₄-Alkylgruppe oder gemeinsam mit R¹ die Gruppe -(CH₂)_KN= bedeutet, wobei k die Zahl 2 oder 3 darstellt,
- RI, falls D ein Sauerstoffatom ist:
- a) ein Wasserstoffatom oder

30

25

b) eine C₁-C₆-Alkylgruppe, die durch 1 bis 3-Fluor-, Chlor- oder Bromatome, eine Hydroxy-, eine C₁-C₃-Alkoxy-, eine C₂-C₄-Alkanoyloxy-, C₁-C₃-Alkylsulfonyloxy-, eine Aminocarbonyloxy-, eine Mono- oder Di-(C₁-C₃-Alkyl)aminocarbonyloxy-, eine Mercapto-, eine C₁-C₃-Alkylmercapto-, eine Phenylmercapto-, eine Pyridylmercapto-, Pyridazinylmercapto-, Pyrimidinylmercapto-, Pyrazinylmercapto- oder eine

the

10

15

20

25

30

Triazinylmercaptogruppe, eine Cyano-, eine Carboxy-, eine $(C_1-C_4-Alkoxy)$ carbonylgruppe, eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 $C_1-C_3-Alkylreste$, 1 bis 2 $C_1-C_3-Alkoxyreste$ und/oder 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome substituiert sein kann, oder eine Imidazolylgruppe, die durch 1 bis 3 $C_1-C_3-Alkylgruppen$ substituiert sein kann, oder eine Gruppe der Formel Ia

$$R^6$$
 $(CH_2)_m$
(Ia)

in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, R^6 ein Wasserstoffatom, eine C_1 - C_4 -Alkylgruppe, die gegebenenfalls durch einen Phenylrest substituiert ist, eine C_3 - C_6 -Cycloalkylgruppe, eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 C_1 - C_4 -Alkylgruppen, 1 oder 2 C_1 - C_4 -Alkoxygruppen oder 1 oder 2 Halogenatome und/oder durch eine Nitril-, Nitro- oder Trifluormethylgruppe substituiert sein kann, oder

eine Gruppe der Formel R^8R^9N- bedeutet, in der R^8 ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe ist, die 1- bis 2-fach durch Halogenatome, $C_1-C_4-Alkylreste$, $C_1-C_4-Alkoxygruppen$ und/oder eine Nitril- und/oder Nitrogruppe substituiert sein kann, R^9 eine $C_1-C_4-Alkanoyl-$ oder Benzoylgruppe bedeutet oder R^8 und R^9 zusammen mit dem Stickstoffatom eine Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe bilden, R^7 dieselben Bedeutungen wie R^6 besitzen kann.

und m für 0, 1 oder 2 steht oder

eine Gruppe der Formel Ib

worin R^{10} einen C_1 - C_3 -Kohlenwasserstoffrest, der durch einen Naphthylrest oder einen Phenylrest substituiert sein kann, wobei der Phenylrest gegebenenfalls 1 bis 2 Halogenatome, 1 bis 2 C_1 - C_4 -Alkylreste, 1 bis 2 C_1 - C_4 -Alkoxyreste oder eine Trifluormethyl-, Nitro-, Hydroxy-, C_1 - C_4 -Alkanyl-, $(C_1$ - C_5 -Alkoxy)-carbonyl- und/oder Cyangruppe enthalten kann, einen Naphthylrest, einen Phenylrest, der 1- bis 3-fach durch Halogenatome, C_1 - C_4 -Alkylreste, C_1 - C_4 -Alkoxygruppen und/oder eine

15

30

Trifluormethyl-oder eine C_1 - C_4 -Alkanoylgruppe substituiert sein kann, oder einen 6-gliedrigen Heteroarylrest mit 1 bis 2 Stickstoffatomen bedeutet und p die Zahl 2 oder 3 darstellt, oder

5 eine Gruppe der Formel Ic,

$$\begin{array}{c} R^{11} \\ R^{12} \end{array} N - \qquad (Ic)$$

worin R^{11} ein Wasserstoffatom, einen C_1 - C_8 -Alkylrest, der gegebenenfalls durch einen Phenylrest, der 1 bis 2 C_1 - C_4 -Alkylgruppen, 1 bis 2 C_1 - C_4 -Alkoxygruppen und/oder 1 bis 2 Halogenatome enthalten kann, substituiert ist, eine C_3 - C_1 2- C_2 0-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 3 Methylgruppen, einen Phenyl-oder Benzylrest substituiert sein kann, oder einen C_7 - C_1 0-Di-oder tricyclischen Alkylrest, der durch 1 bis 3 Methylreste substituiert sein kann, oder eine benzokondensierte C_5 - C_7 - C_2 0-Cycloalkylgruppe bedeutet und C_1 0 wasserstoffatom oder einen C_1 - C_8 -Alkylrest bedeutet, oder

eine Gruppe der Formel Id,

worin n die Zahl 1, 2 oder 3 bedeutet und der aromatische Ring durch 20 l bis 2 Halogenatome, 1 bis 2 C_1 - C_4 -Alkylreste oder 1 bis 2 C_1 - C_4 -Alkoxyreste substituiert sein kann, oder

eine Gruppe der Formel Ie,

worin G für Sauerstoff- oder Schwefelatom steht und der heterocyclische Ring durch 1 bis 2 C_1 - C_4 -Alkylgruppen substituiert sein kann,

darstellt, oder

c) eine C_2 - C_6 -Alkenylgruppe bedeutet, die durch 1 Chloratom oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

- d) eine C3-C6-Alkinylgruppe darstellt oder
- e) eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe darstellt, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylgruppen und/oder 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome und/oder durch
 5 l Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- f) eine Phenylgruppe darstellt, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylgruppen, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxygruppen, 1 bis 2 Fluor-, Chlor-oder Bromatome, eine Aminogruppe, eine Mono- oder Di-C₁-C₃-Alkylaminogruppe, eine C₂-C₄-Alkoxy- alkanoylaminogruppe, eine Carboxygruppe oder eine C₁-C₄-Alkoxy- carbonylgruppe substituiert sein kann, oder
- g) eine Pyridyl, Pyridazinyl-, Pyrimidinyl-, Pyrazinyl- oder Triazinylgruppe darstellt, die durch 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen und/oder eine C₁-C₃-Alkoxygruppe, eine Hydroxygruppe, eine Aminogruppe, eine Monooder Di-C₁-C₃-Alkoxygruppe substituiert sein kann, oder
- n) eine 5-gliedrige aromatische heterocyclische Gruppe darstellt, die als Heteroatome 1 Sauerstoff-, 1 Schwefel- und/oder 1, 2 oder 3 Stick stoffatome enthält und ggf. mit 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen substituiert ist, oder
- i) eine C₁-C₆-Alkoxygruppe darstellt, die eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, ein bis zwei Chlor- oder Bromatome, eine C₁-C₃-Alkoxygruppe oder eine
 25 Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkyl-, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxy-, 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome, einen Trifluormethylrest oder eine Nitrogruppe substituiert sein kann, tragen kann, oder
- j) eine C₃-C₆-Alkenyloxygruppe darstellt, die durch eine Phenylgruppe
 substuiert sein kann, oder
 - k) eine C₃-C₆-Alkinyloxygruppe darstellt, die durch einen Phenylrest substituiert sein kann, oder
- 35 l) eine C_3 - C_6 - C_9 cloalkyloxygruppe darstellt, die durch l bis 2 C_1 - C_3 -Alkylgruppen und/oder l bis 2 Chlor- oder Bromatome substituiert sein kann, oder
- m) eine Phenoxygruppe darstellt, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylreste, 40 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxygruppen, I bis 2 Fluor- oder Chloratome oder eine Nitrogruppe substituiert sein kann, oder

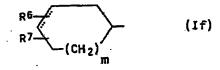
20

30

oder

- n) eine C1-C3-Alkylmercaptogruppe darstellt, oder.
- o) die Gruppe $R^{13}R^{14}$ N darstellt, wobei R^{13} für ein Wasserstoffatom, eine C_1 - C_3 -Alkyl-, eine C_3 - C_4 -Alkenyl- oder eine C_3 - C_4 -Alkinylgruppe oder eine Phenylgruppe steht und R^{14} ein Wasserstoffatom oder eine C_1 - C_3 -Alkylgruppe bedeutet, oder
- R.E., falls D ein Schwefelatom darstellt,
- IO eine $C_1-C_4-Alkylaminogruppe$ oder eine $Di-(C_1-C_4-Alkyl)$ aminogruppe bedeutet, oder
- R^{I} , falls D die Gruppe =N-CN darstellt, für ein Wasserstoffatom, eine C_1 - C_4 -Alkylgruppe, eine Phenylgruppe, eine C_1 - C_4 -Alkylamino- oder eine $Di(C_1$ - C_4 -Alkyl) aminogruppe steht, oder
 - \mathbb{R}^1 , falls D die Gruppe =NE darstellt, ein Wasserstoffatom, eine C_1 - C_4 -Alkylgruppe, eine Phenylgruppe, eine Pyridinylgruppe, eine C_1 - C_4 -Alkinylamino- oder eine Di- $(C_1$ - C_4 -Alkyl)-aminogruppe bedeutet,
 - R^2 ein Wasserstoffatom oder eine C_{1-3} -Alkylgruppe darstellt,
- oder \mathbb{R}^1 und \mathbb{R}^2 gemeinsam eine \mathbb{C}_2 - \mathbb{C}_4 -Alkylidengruppe bilden, die durch \mathbb{E} bis 2 \mathbb{C}_{1-3} -Alkylgruppen und/oder eine Phenylgruppe substituiert sein 25 kann,
 - $\mathbf{R}^{\mathbf{J}'}$ und $\mathbf{R}^{\mathbf{4}}$ unabhängig voneinander stehen für
 - a) ein Wasserstoffatom oder
- b): eine C₁-C₆-Alkylgruppe, die durch 1 bis 3-Fluor-, Chlor- oder Bromatome, eine Hydroxy-, eine C₁-C₃-Alkoxy, eine C₂-C₄-Alkanoyloxy-, eine C₁-C₃-Alkylsulfonyloxy-, eine Aminocarbonyloxy-, eine Mono- oder Di-(C₁-C₃-Alkyl)aminocarbonyloxy-, eine Mercapto-, eine C₁-C₃-Alkyl-mercapto-, eine Phenylmercapto-, eine Pyridylmercapto-, Pyridazinylmercapto-, Pyrimidinylmercapto-, Pyrazinylmercapto- oder eine Triazinylmercaptogruppe, eine Cyano, eine Carboxy-, eine (C₁-C₄-Alkoxy)carbonylgruppe, eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylreste, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxyreste und/oder 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome substituiert sein kann, oder eine Imidazolyl-gruppe, die durch 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen substituiert sein kann,

eine Gruppe der Formel If,

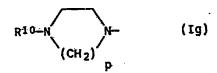


in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, R⁶ ein Wasserstoffatom, eine C₁-C₄-Alkylgruppe, die gegebenenfalls durch 5 einen Phenylrest substituiert ist, eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 C₁C₄-Alkylgruppen, 1 oder 2 C₁C₄-Alkoxygruppen oder 1 oder 2 Halogenatome und/oder durch eine Mitril-, Nitro- oder Trifluormethylgruppe substituiert sein kann, oder

If eine Gruppe der Formel R^8R^9N - bedeutet, in der R^8 ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe ist, die 1- bis 2-fach durch Halogenatome, C_1 - C_4 -Alkyl-reste, C_1 - C_4 -Alkoxygruppen und/oder eine Nitril- und/oder Nitrogruppe substituiert sein kann, R^9 eine C_1 - C_4 -Alkanoyl oder eine Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe darstellt, R^7 dieselben Bedeutungen wie R^6 besitzen kann,

und m für 0, 1 oder 2 steht oder

eine Gruppe der Formel Ig,



20

10

worin R^{10} einen C_1 - C_3 -Kohlenwasserstoffrest, der durch einen Naphthylrest oder einen Phenylrest substituiert sein kann, wobei der Phenylrest gegebenenfalls 1 bis 2 Halogenatome, 1 bis 2 C_1 - C_4 -Alkylreste, 1 bis 2 C_1 - C_4 -Alkoxyreste oder eine Trifluormethyl-, Nitro-, Hydroxy-, C_1 - C_4 -Alkanyl-, $(C_1$ - C_5 -Alkoxy)-carbonyl- und/oder Cyangruppe enthalten kann, einen Naphthylrest, einen Phenylrest, der 1- bis 3-fach durch Halogenatome, C_1 - C_4 -Alkylreste, C_1 - C_4 -Alkoxygruppen und/oder eine Trifluormethyl-oder eine C_1 - C_4 -Alkanoylgruppe substituiert sein kann, oder einen 6-gliedrigen Heteroarylrest mit 1 bis 2 Stickstoffatomen bedeutet und p die Zahl 2 oder 3 darstellt, oder

eine Gruppe der Formel Ih,

worin R¹¹ ein Wasserstoffatom, einen C₁-C₈-Alkylrest, der gegebenenfalls durch einen Phenylrest, der 1 bis 2 C₁-C₄-Alkylgruppen, 1 bis 2
C₁-C₄-Alkoxygruppen und/oder 1 bis 2 Halogenatome enthalten kann,
substituiert ist, eine C₃-C₁₂-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 3
Methylgruppen, einen Phenyl-oder Benzylrest substituiert sein kann,
oder einen C₇-C₁₀bi oder tricyclischen Alkylrest, der durch 1 bis 3
Methylreste substituiert sein kann, oder eine benzokondensierte
C₅-C₇-Cycloalkylgruppe bedeutet und R¹² ein Wasserstoffatom oder einen
C₁-C₈-Alkylrest bedeutet, oder

- c) eine C_2 - C_6 -Alkenylgruppe, die durch 1 Chloratom oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
 - d) eine C3-C6-Alkinylgruppe oder
- e) eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylgruppen 30 und/oder 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome und/oder durch 1 Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- f) eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylgruppen, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxygruppen, 1 bis 2 Fluor-, Chlor-oder Bromatome, eine 35 Aminogruppe, eine Mono- oder Di-C₁-C₃-Alkylaminogruppe, eine C₂-C₄-Alkanoylaminogruppe, eine Carboxygruppe oder eine C₁-C₄-Alkoxy-carbonylgruppe substituiert sein kann, oder

- g) eine Pyridyl, Pyridazinyl-, Pyrimidinyl-, Pyrazinyl- oder Triazinylgruppe, die durch 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen und/oder eine C₁-C₃-Alkoxygruppe, eine Hydroxygruppe, eine Aminogruppe, eine Moπo- oder Di-C₁-C₃-Alkoxygruppe substituiert sein kann, oder
- h) eine 5-gliedrige aromatische heterocyclische Gruppe, die als Heteroatome 1 Sauerstoff-, 1 Schwefel- und/oder 1, 2 oder 3 Stickstoffatome enthält und ggf. mit 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen substituiert ist, oder
- eine C_1 - C_6 -Alkoxygruppe, die eine C_3 - C_6 -Cycloalkylgruppe, ein bis zwei Chlor- oder Bromatome, eine C_1 - C_3 -Alkoxygruppe oder eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C_1 - C_3 -Alkyl-, 1 bis 2 C_1 - C_3 -Alkoxy-, 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome, einen Trifluormethylrest oder eine Nitrogruppe substituiert sein kann, tragen kann, oder
- i) eine C3-C6-Alkenyloxygruppe, die durch eine Phenylgruppe substuiert sein kann, oder
- k) eine C3-C6-Alkinyloxygruppe, die durch einen Phenylrest substituiert
 zo sein kann, oder
 - 1) eine C_3 - C_6 -Cycloalkyloxygruppe, die durch 1 bis 2 C_1 - C_3 -Alkylgruppen und/oder 1 bis 2 Chlor- oder Bromatome substituiert sein kann, oder
- 25 m) eine Phenoxygruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylreste, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxygruppen, 1 bis 2 Fluor- oder Chloratome oder eine Nitrogruppe substituiert sein kann, oder
 - n) eine C₁-C₃-Alkylmercaptogruppe, oder
 - o) die Gruppe $R^{13}R^{14}N$, wobei R^{13} für ein Wasserstoffatom, eine C_1 - C_3 -Alkyl-, eine C_3 - C_4 -Alkenyl- oder eine C_3 - C_4 -Alkinylgruppe oder eine Phenylgruppe steht und R^{14} ein Wasserstoffatom oder eine C_1 - C_3 -Alkyl-gruppe bedeutet; und

_R5

30

- a) ein Wasserstoffatom
- 40 b) eine C_1 - C_6 -Alkylgruppe, die durch 1-3 Fluor-, Chlor- oder Bromatome, eine Hydroxy-, eine Cyano- oder Carboxygruppe substituiert sein kann,

- c) ein Halogenatom, oder
- d) eine Cyano-, Carboxy-, Nitro-, Nitroso-, Hydroxy- oder Aminogruppe, die durch ein oder zwei C₁-C₆-Alkylreste mit gegebenenfalls einem Halogenatom oder einer Hydroxygruppe substituiert sein kann.

darstellt;

oder ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel II

10

5

in der A, B, D, \mathbb{R}^3 , \mathbb{R}^4 und \mathbb{R}^5 die für Formel I angegebenen Bedeutungen besitzen, und

 $\mathsf{R}^{\mathsf{I}\mathsf{5}}$ ein Wasserstoffatom, einen C $_{\mathsf{1-4}}$ -Alkylrest, eine Phenyl-, eine 15 Hydroxy-, eine C₁₋₄-Alkoxy-, eine Phenoxygruppe, die Gruppe R^{18} -NH-CH₂-CH(OH)-CH₂O-, in der R^{18} die Isopropyl- oder tert.-Butylgruppe bedeutet, eine Nitro-, Trifluormethyl-, Carboxy-, C1-C4-Alkoxycarbonyl-, Aminocarbonyl- oder Cyanogruppe, ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom, eine Amino-, C_{1-4} -Alkylamino-, oder Di(C_{1} - C_{4} -Alkyl)-aminogruppe, einen 20 Pyrrolidin-, Piperidin- oder Morpholinrest, oder die Gruppe -NH-CH2-J, wobei J einen Pyridyl-, Furyl-, Thienyl- oder Phenylrest bedeutet, wobei der Phenylrest durch 1 bis 3 Reste aus der Gruppe Halogen, Hydroxy, $C_1-C_4-Alkoxy$) carbonyl oder $C_1-C_4-Alkyl$ substituiert sein kann, oder eine Gruppe -NHL, worin L eine 5- oder 6-gliedrige heterocyclische Gruppe, die 25 1 N-, 0- oder S-Atom und gegebenenfalls 1 bis 2 weitere N-Atome besitzt, bedeutet, wobei die heterocyclische Gruppe durch einen Rest aus der Gruppe Cyano, Hydroxy, $C_1-C_4-Alkoxy$, Amino, $C_1-C_4-Alkylamino$, $Di-(C_1-C_4-Alkyl)$ amino, $(C_1-C_4-Alkoxy)$ carbonyl, Aminocarbonyl oder $C_1-C_4-Alkanoyl$ oder durch 1 bis 3 C1-C4-Alkylgruppen, wobei eine dieser C1-C4-Alkylgruppen 30 durch eine Hydroxygruppe oder den Rest $R^{19}R^{20}N$ substituiert sein kann, wobei R¹⁹ und R²⁰ unabhängig voneinander Wasserstoffatome, C1-C4-Alkylreste, Benzyl- oder Phenethylgruppen bedeuten

oder die Gruppe ${\tt R}^{19}{\tt R}^{20}{\tt N}$ für eine Pyrrolidin-, Piperidin- oder Morpholin-rest steht, substituiert sein kann,

oder ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel III

 $\begin{array}{c}
R^{19} \\
R^{20} \\
\end{array}$ $\begin{array}{c}
R^{5} \\
R \\
\end{array}$ $\begin{array}{c}
R^{5} \\
R \\
\end{array}$ $\begin{array}{c}
R^{4} \\
R^{3}
\end{array}$ (III)

in der \mathbb{R}^3 , \mathbb{R}^4 und \mathbb{R}^5 , A und B die für Formel I vorstehend angegebenen Bedeutungen besitzen,

 $\rm X$ und $\rm Y$ unabhängig voneinander ein N-Atom oder ein Kohlenstoffatom, das 10 durch ein Wasserstoffatom oder einen der Reste R¹⁹, R²⁰ oder R²¹ substituiert ist, bedeuten, wobei

 R^{19} ein Wasserstoffatom, eine C_1 - C_4 -Alkylgruppe, eine C_1 - C_4 -Hydroxyalkyl-gruppe, eine C_1 - C_4 -Alkanoyl-, eine Hydroxycarbonyl, eine $(C_1$ - C_4 -Alkoxy)-15 carbonyl-, eine Aminocarbonyl-, eine Cyanogruppe oder eine Gruppe der Formel IIIa

bedeutet, wobei

25

20 R²² eine C₁-C₆-Alkyl-, eine Phenyl-(C₁-C₃-Alkyl)-, eine C₁-C₄-Alkanoyl-, eine Benzoyl-, eine Pyridincarbonyl- oder eine C₁-C₄-Alkylsulfonylgruppe bedeutet,

 R^{23} ein Wasserstoffatom oder eine C1-C6-Alkylgruppe bedeutet, oder

 R^{22} und R^{23} gemeinsam mit dem N-Atom, an das sie gebunden sind, einen Pyrrolidin-, Piperidin- oder Piperazinrest bedeuten, der durch eine Phenylgruppe und/oder eine Hydroxygruppe substituiert sein kann,

R²⁴ eine C₁-C₄-Alkylidengruppe bedeutet, und

 R^{20} und R^{21} unabhängig voneinander Wasserstoffatome oder $\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4\mathsf{-}\mathsf{Alkylgruppen}$ bedeuten,

oder die physiologisch verträglichen Salze der Verbindungen der allgemeinen Formeln I, II und III.

Bevorzugte Verbindungen für das erfindungsgemäße Mittel und die 10 erfindungsgemäße Verwendung sind Uracil-Derivate der allgemeinen Formel I,

$$\begin{array}{c|c}
R^5 & N & R^4 \\
\hline
R^1 & N & R^2
\end{array}$$

in der

A und B entweder jeweils ein Wasserstoffatom bedeuten oder zusammen eine Bindung bilden,

15

D ein Sauerstoffatom bedeutet,

R¹ die folgenden Bedeutungen besitzt:

a) ein Wasserstoffatom oder

20

b) eine C₁-C₃-Alkylgruppe, die durch ein Chloratom, eine Hydroxy-, eine Methoxy-, eine Acetoxy-, eine Methylmercapto-, eine Pyridiylmercapto-, eine Cyano-, eine Carboxy-, eine (C₁₋₄-Alkoxy)-carbonyl- oder eine Phenylgruppe oder eine Gruppe der Formel Ia,

25

$$R^6$$
 (CH_2)
 (Ia)

in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, und R^6 ein Wasserstoffatom, eine Methylgruppe ist, eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 Methyl-, Methoxygruppen oder Chloratome substituiert sein kann, oder eine Gruppe der Formel R^8R^9N bedeutet, in der 30 R^8 ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe und R^9 eine Propionyl- oder Benzoylgruppe bedeutet oder R^8 und R^9 zusammen mit dem Stickstoffatom eine

Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe bilden, R^7 ein Wasserstoffatom, eine Methyl, eine Hydroxy-, eine Acetyl-, eine Ethoxycarbonyl oder eine Cyanogruppe bedeutet,

5 m für 1 steht oder

eine Gruppe der Formel Ib

worin R¹⁰ einen Benzyl-, einen Naphthyl- oder einen Phenylrest, der 1- bis 10 3-fach durch Chloratome, Methyl- und/oder Methoxygruppen substituiert sein kann, oder einen Pyridylrest bedeutet und

p die Zahl 2 bedeutet, oder

15 eine Gruppe der Formel Ic,

worin R^{11} einen $\mathsf{C}_1\text{-}\mathsf{C}_3\text{-}\mathsf{AlkyIrest},$ der gegebenenfalls durch einen Phenylrest substituiert ist, und R^{12} ein Wasserstoffatom oder einen Methylrest bedeuten, oder

20

eine Gruppe der Formel Id,

worin n die Zahl 2 bedeutet, oder

25 eine Gruppe der Formel Ie,

worin G für ein Wasserstoffatom steht und der heterocyclische Ring durch 1 bis $2\ C_1-C_4-Alkylgruppen$ substituiert sein kann, oder

- c) eine C_2 - C_4 -Alkenylgruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- d) eine C3-C4-Alkinylgruppe oder

- e) eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen und/oder 1 bis 2 Chloratome und/oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- 10 f) eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen, 1 bis 2 Methoxygruppen, 1 bis 2 Chloratome, eine Carboxygruppe oder eine Ethoxycarbonylgruppe substiuiert sein kann, oder
- g) eine Pyridylgruppe, die durch 1 bis 3 Methylgruppen substituiert sein
 kann, oder
 - h) eine Thiophenyl-, Furanyl-, Imidazolyl- oder Oxazolylgruppe, die gegebenenfalls mit 1 bis 3 Methylgruppen substituiert ist, oder
- 20 i) eine C₁-C₄-Alkoxygruppe, die durch eine Methoxygruppe oder durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
 - j) eine C₃-C₄-Alkenyloxygruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

25

- k) eine C₃-C₄-Alkinyloxygruppe, die durch einen Phenylrest substituiert sein kann, oder
- 1) eine C3-C6-Cycloalkoxygruppe oder

30

- m) eine Phenoxygruppe oder
- n) eine Methylmercaptogruppe oder
- 35 o) die Gruppe $R^{13}R^{14}N^{-}$, wobei R^{13} für ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, eine Allyl- oder eine Propionylgruppe steht und R^{14} ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe bedeutet,
 - R² ein Wasserstoffatom bedeutet

40

oder \mathbb{R}^1 und \mathbb{R}^2 gemeinsam eine \mathbb{C}_2 - \mathbb{C}_4 -Alkylidengruppe bilden, die durch 1 bis 2 Methylgruppen substituiert sein kann,

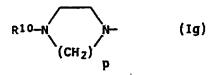
R³ und R⁴ unabhängig voneinander stehen für

- a) ein Wasserstoffatom oder
- 5 b) eine C₁-C₃-Alkylgruppe, die durch ein Chloratom, eine Hydroxy-, eine Methoxy-, eine Acetoxy-, eine Methylmercapto-, eine Pyridiylmercapto-, eine Cyano-, eine Carboxy-, eine (C₁₋₄-Alkoxy)-carbonyl- oder eine Phenylgruppe oder eine Gruppe der Formel If,

$$R^6$$
 $(CH_2)_m$

- in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, und R⁶ ein Wasserstoffatom, eine Methylgruppe ist, eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 Methyl-, Methoxygruppen oder Chloratome substituiert sein kann, oder eine Gruppe der Formel R⁸R⁹N bedeutet, in der R⁸ ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe und R⁹ eine Propionyl- oder Benzoylgruppe bedeutet oder R⁸ und R⁹ zusammen mit dem Stickstoffatom eine Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe bilden, R⁷ ein Wasserstoffatom, eine Methyl, eine Hydroxy-, eine Acetyl-, eine Ethoxycarbonyl- oder eine Cyanogruppe bedeutet,
- 20 m für 1 steht oder

eine Gruppe der Formel Ig,



worin R¹⁰ einen Benzyl-, einen Naphthyl- oder einen Phenylrest, der 1-25 bis 3-fach durch Chloratome, Methyl- und/oder Methoxygruppen substituiert sein kann, oder einen Pyridylrest bedeutet und

p die Zahl 2 bedeutet, oder

eine Gruppe der Formel Ih

worin R^{11} einen $C_1-C_3-Alkylrest$, der gegebenenfalls durch einen Phenylrest substituiert ist, und R^{12} ein Wasserstoffatom oder einen Methylrest bedeuten, oder

- c) eine C_2 - C_4 -Alkenylgruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- 10 d) eine C3-C4-Alkinylgruppe oder
 - e) eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen und/oder 1 bis 2 Chloratome und/oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- f) eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen, 1 bis 2 Methoxygruppen, 1 bis 2 Chloratome, eine Carboxygruppe oder eine Ethoxycarbonylgruppe substiuiert sein kann, oder
- 20 g) eine Pyridylgruppe, die durch 1 bis 3 Methylgruppen substituiert sein kann, oder
- h) eine Thiophenyl-, Furanyl-, Imidazolyl- oder Oxazolylgruppe, die gegebenenfalls mit 1 bis 3 Methylgruppen substituiert ist, oder
 25
 - i) eine C_1 - C_4 -Alkoxygruppe, die durch eine Methoxygruppe oder durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- j) eine C₃-C₄-Alkenyloxygruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert
 sein kann, oder
 - k) eine C₃-C₄-Alkinyloxygruppe, die durch einen Phenylrest substituiert sein kann, oder
- 35 1) eine C3-C6-Cycloalkoxygruppe oder
 - m) eine Phenoxygruppe oder

40

n) eine Methylmercaptogruppe oder

die Gruppe $R^{13}R^{14}N$ -, wobei R^{13} für ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, eine Allyl- oder eine Propionylgruppe steht und R^{14} ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe bedeutet; und

5 R⁵

- a) ein Wasserstoffatom
- b) eine C₁-C₃-Alkylgruppe, die endständig durch ein Fluor-, Chlor-oder
 Bromatom, eine Hydroxy-, eine Cyano- oder Carboxygruppe substituiert sein kann,
 - c) ein Brom- oder Chloratom, oder
- 15 d) eine Cyano-, Carboxy-, Nitro-, Nitroso-, Hydroxy- oder Aminogruppe, die durch ein oder zwei C₁-C₃ mit gegebenenfalls endständigen Chloratom oder einer Hydroxygruppe substituiert sein kann,

darstellt;

20

oder ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel II

in der

- 25 A und B entweder jeweils ein Wasserstoffatom bedeuten oder zusammen eine Bindung bilden,
 - D ein Sauerstoffatom bedeutet,
- 30 R³ und R⁴ unabhängig voneinander stehen für
 - a) ein Wasserstoffatom oder

b) eine C_1 - C_3 -Alkylgruppe, die durch ein Chloratom, eine Hydroxy-, eine Methoxy-, eine Acetoxy-, eine Methylmercapto-, eine Pyridiylmercapto-, eine Cyano-, eine Carboxy-, eine (C_{1-4} -Alkoxy)-carbonyl- oder eine Phenylgruppe oder eine Gruppe der Formel If,

 R^6 (If)

in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, und R⁶ ein Wasserstoffatom, eine Methylgruppe ist, eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 Methyl-, Methoxygruppen oder Chloratome substituiert sein kann, oder eine Gruppe der Formel R⁸R⁹N bedeutet, in der R⁸ ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe und R⁹ eine Propionyl- oder Benzöylgruppe bedeutet oder R⁸ und R⁹ zusammen mit dem Stickstoffatom eine Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe bilden, R⁷ ein Wasserstoffatom, eine Methyl, eine Hydroxy-, eine Acetyl-, eine Ethoxycarbonyl oder eine Cyanogruppe bedeutet,

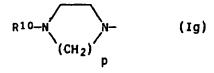
15

10

5

m für 1 steht, oder

eine Gruppe der Formel Ig,



worin R¹⁰ einen Benzyl-, einen Naphthyl- oder einen Phenylrest, der 1bis 3-fach durch Chloratome, Methyl- und/oder Methoxygruppen substituiert sein kann, oder einen Pyridylrest bedeutet und

p die Zahl 2 bedeutet, oder

25

30

eine Gruppe der Formel Ih,

worin R^{11} einen C_1 - C_3 -Alkylrest, der gegebenenfalls durch einen Phenylrest substituiert ist, und R^{12} ein Wasserstoffatom oder einen Methylrest bedeuten, oder

c) eine C₂-C₄-Alkenylgruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

- d) eine C3-C4-Alkinylgruppe oder
- e) eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen und/oder 1 bis 2 Chloratome und/oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann,
 oder
 - f) eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen, 1 bis 2 Methoxygruppen, 1 bis 2 Chloratome, eine Carboxygruppe oder eine Ethoxycarbonylgruppe substiuiert sein kann, oder

g) eine Pyridylgruppe, die durch 1 bis 3 Methylgruppen substituiert sein kann, oder

- h) eine Thiophenyl-, Furanyl-, Imidazolyl- oder Oxazolylgruppe, die
 gegebenenfalls mit 1 bis 3 Methylgruppen substituiert ist, oder
 - i) eine C_1 - C_4 -Alkoxygruppe, die durch eine Methoxygruppe oder durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- 20 j) eine C3-C4-Alkenyloxygruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
 - k) eine C₃-C₄-Alkinyloxygruppe, die durch einen Phenylrest substituiert sein kann, oder
 - 1) eine C₃-C₆-Cycloalkoxygruppe oder
 - m) eine Phenoxygruppe oder
- 30 n) eine Methylmercaptogruppe oder
 - o) die Gruppe $R^{13}R^{14}N^{-}$, wobei R^{13} für ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, eine Allyl- oder eine Propionylgruppe steht und R^{14} ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe bedeutet; und

35 _R5

25

- a) ein Wasserstoffatom
- 40 b) eine C₁-C₃-Alkylgruppe, die endständig durch ein Fluor-, Chlor-oder Bromatom, eine Hydroxy-, eine Cyano- oder Carboxygruppe substituiert sein kann,
 - c) ein Brom- oder Chloratom, oder

- d) eine Cyano-, Carboxy-, Nitro-, Nitroso-, Hydroxy- oder Aminogruppe, die durch ein oder zwei C₁-C₃ mit gegebenenfalls endständigen Chloratom oder einer Hydroxygruppe substituiert sein kann,
- 5 darstellt; und

R:15

a); ein Wasserstoffatom

EQ.

- br) einen C1-C4-Alkylrest,
- c); eine Cyano-, Carboxy- oder Aminogruppe, die durch gegebenenfalls ein bis zwei $C_1-C_3-Alkylgruppen$ substituiert sein kann

1150

- d) einen Piperidinrest
- e) die Gruppe NHCH2J, wobei J ein Pyridiyl-, Furyl-, Thionyl- oder Phenylrest bedeutet,

20

f); die Gruppe NHL, worin L einen Pyridyl- oder einen Thiazolylrest bedeutet, wobei der Pyridyl- oder der Thiazolylrest durch 1-2 Methylgruppen substituiert sein kann,

25 darstellt;

oder ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel III

im der

30

A und B entweder jeweils ein Wasserstoffatom bedeuten oder zusammen eine Bindung bilden,

D ein Sauerstoffatom bedeutet,

35

 ${\bf R}^{(3)}$ und ${\bf R}^4$ unabhängig voneinander stehen für

a) ein Wasserstoffatom oder

10

15

25

30

b) eine C₁-C₃-Alkylgruppe, die durch ein Chloratom, eine Hydroxy-, eine Methoxy-, eine Acetoxy-, eine Methylmercapto-, eine Pyridiylmercapto-, eine Cyano-, eine Carboxy-, eine (C₁₋₄-Alkoxy)-carbonyl- oder eine Phenylgruppe oder eine Gruppe der Formel If,

 R^6 $(CH_2)_m$

in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, und R^6 ein Wasserstoffatom, eine Methylgruppe ist, eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 Methyl-, Methoxygruppen oder Chloratome substituiert sein kann, oder eine Gruppe der Formel R^8R^9N bedeutet, in der R^8 ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe und R^9 eine Propionyl- oder Benzoylgruppe bedeutet oder R^8 und R^9 zusammen mit dem Stickstoffatom eine Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe bilden, R^7 ein Wasserstoffatom, eine Methyl, eine Hydroxy-, eine Acetyl-, eine Ethoxycarbonyl oder eine Cyanogruppe bedeutet,

m für 1 steht oder

eine Gruppe der Formel Ig,

$$R^{10-N}$$
 (Ig)

worin R¹⁰ einen Benzyl-, einen Naphthyl- oder einen Phenylrest, der 1bis 3-fach durch Chloratome, Methyl- und/oder Methoxygruppen substituiert sein kann, oder einen Pyridylrest bedeutet und

p die Zahl 2 bedeutet. oder

eine Gruppe der Formel Ih

worin R^{11} einen C_1 - C_3 -Alkylrest, der gegebenenfalls durch einen Phenylrest substituiert ist, und R^{12} ein Wasserstoffatom oder einen Methylrest bedeuten, oder

- c) eine C2-C4-Alkenylgruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- d) eine C3-C4-Alkinylgruppe oder

- e) eine C_3 - C_6 -Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen und/oder 1 bis 2 Chloratome und/oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- 10 f) eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen, 1 bis 2 Methoxygruppen, 1 bis 2 Chloratome, eine Carboxygruppe oder eine Ethoxycarbonylgruppe substiuiert sein kann, oder
- g) eine Pyridylgruppe, die durch 1 bis 3 Methylgruppen substituiert sein
 kann, oder
 - h) eine Thiophenyl-, Furanyl-, Imidazolyl- oder Oxazolylgruppe, die gegebenenfalls mit 1 bis 3 Methylgruppen substituiert ist, oder
- 20 i) eine C_1 - C_4 -Alkoxygruppe, die durch eine Methoxygruppe oder durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann,
 - j) eine C₃-C₄-Alkenyloxygruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

25

- k) eine C3-C4-Alkinyloxygruppe, die durch einen Phenylrest substituiert sein kann, oder
- eine C3-C6-Cycloalkoxygruppe oder

30

- m) eine Phenoxygruppe oder
- n) eine Methylmercaptogruppe oder
- 35 o) die Gruppe $R^{13}R^{14}N^{-}$, wobei R^{13} für ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, eine Allyl- oder eine Propionylgruppe steht und R^{14} ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe bedeutet; und

_R5

- a) ein Wasserstoffatom
- eine C₁-C₃-Alkylgruppe, die endständig durch ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom, eine Hydroxy-, eine Cyano- oder Carboxygruppe substituiert sein kann,

- c) ein Brom- oder Chloratom, oder
- d) eine Cyano-, Carboxy-, Nitro-, Nitroso-, Hydroxy- oder Aminogruppe,
 die durch ein oder zwei C₁-C₃ mit gegebenenfalls endständigen
 5 Chloratom oder einer Hydroxygruppe substituiert sein kann,

darstellt:

und der Rest

IO

insgesamt bedeutet: einen Imidazol-1-yl-rest, der durch 1-3 Methylgruppen oder eine Hydroxymethylgruppe substituiert sein kann,

oder einen 1,2,4-Triazol-1-yl-rest, einen Pyrazol-1-yl-rest, einen Pyrazol-1-yl-rest oder einen Pyrrol-1-yl-rest, der durch eine Hydroxymethylgruppe, eine Formylgruppe, eine Acetylgruppe oder eine Gruppe der Formel IIIa,

substituiert sein kann, in der R^{22} eine C_1 - C_3 -Alkyl-, eine Benzyl-, eine C_1 - C_4 -Alkanoyl oder eine Benzoylgruppe bedeutet,

 $\ensuremath{\text{R}^{23}}$ ein Wasserstoffatom oder eine $\ensuremath{\text{C}_1\text{--}\text{C}_6\text{--}}\ensuremath{\text{Alkylgruppe}}$ bedeutet, oder

R²² und R²³ gemeinsam mit dem N-Atom einen Piperidin- oder Piperazinrest darstellen, der durch eine Phenylgruppe substituiert ist,

 R^{24} eine C_1 - C_3 -Alkylidengruppe bedeutet;

oder die physiologisch verträglichen Salze der Verbindungen der 30 allgemeinen Formeln I, II und III.

Das erfindungsgemäße Mittel liegt bevorzugt in Form von Tierfutter, Trinkwasser für Tiere, Zusätzen für Tierfutter und Trinkwasser oder in Form eines Prämixes vor.

Gegenstand der Erfindung ist auch die Verwendung der Uracil-Derivate der allgemeinen Formeln I, II und III zur Leistungssteigerung bei der Tierzucht, insbesondere zur Wachstumsförderung, Verbesserung der Futterverwertung, Erhöhung des Proteinanteils und/oder Verringerung des 5 Fettgehalts bei Tieren.

Herstellverfahren für die im erfindungsgemäßen Mittel eingesetzten Verbindungen sind bekannt und werden zum Beispiel beschrieben in den folgenden Literaturstellen:

10

- a) DE-B 834 105
- b) E.C. Taylor und A. Mc Killop, J. Org. Chem. 30, 3153 (1965)
- 15 c) D.T. Hurst, An Introduction to the Chemistry and Biochemistry of Pyrimidines, Purines and Pteridines; Wiley (1980)
 - d) D.J. Brown, The Pyrimidines; Wiley (1962); Suppl. 1 (1970)
- **20** Suppl. 2 (1985)

Soweit die Verbindungen der Formeln I, II und III bekannt sind, zeigen sie in bekannter Weise cyctostatische, thyreostatische und diuretische Wirkungen.

25

Derartige Wirkungen werden z.B. beschrieben in

 M. Negwer, Organisch-chemische Arzneimittel und ihre Synonyma, Akademie-Verlag, Berlin 1978

30

2) den bei den Herstellverfahren genannten Literaturstellen a) bis d).

Überraschend wurde nun gefunden, daß die Verbindungen der allgemeinen Formeln I, II und III eine wachstumsfördernde und fettreduzierende Wirkung 35 besitzen.

Die Wirkstoffe können in allen Bereichen der Tierzucht als Mittel zur Förderung und Beschleunigung des Wachstums, zur Verbesserung der Futterverwertung, Verminderung des Fettansatzes sowie Zunahme des Protein-40 ansatzes bei gesunden und kranken Tieren verwendet werden.

Die Wirksamkeit der Wirkstoffe ist hierbei weitgehend unabhängig von der Art und dem Geschlecht der Tiere. Besonders wertvoll erweisen sich die Wirkstoffe bei der Aufzucht und Haltung von Jung- und Masttieren. Als

Tiere, bei denen die Wirkstoffe zur Förderung und Beschleunigung des Wachstums und zur Verbesserung der Futterverwertung eingesetzt werden können, seien beispielsweise folgende Nutz- und Ziertiere genannt:

- 5 Warmblüter wie Rinder, Schweine, Pferde, Schafe, Ziegen, Katzen, Hunde, Kaninchen, Pelztiere, z.B. Nerze und Chinchilla, Geflügel, z.B. Hühner, Gänse, Enten, Truthähne, Tauben, Papageien und Kanarienvögel und Kaltblüter wie Fische, z.B. Karpfen und Reptilien, z.B. Schlangen.
- 10 Die Wirkstoffdosis, die den Tieren zur Erreichung des gewünschten Effektes verabreicht wird, kann wegen der günstigen Eigenschaften der Wirkstoffe weitgehend variiert werden. Sie liegt vorzugsweise bei etwa 0,01 bis 100 mg Wirkstoff/kg Futter, insbesondere 0,1 bis 10 mg Wirkstoff/kg Futter oder Trinkwasser. Die Dauer der Verabreichung kann von wenigen Stunden
- 15 oder Tagen bis zu mehreren Jahren betragen. Die passende Menge des Wirkstoffs sowie die passende Dauer der Verabreichung hängen insbesondere von der Art, dem Alter, dem Geschlecht, dem Gesundheitszustand und der Art der Haltung und Fütterung der Tiere ab und sind von jedem Fachmann leicht zu ermitteln.

20

Die Wirkstoffe werden den Tieren nach den üblichen Methoden verabreicht. Die Art der Verabreichung hängt insbesondere von der Art, dem Verhalten und dem Gesundheitszustand der Tiere ab. So kann die Verabreichung einmal oder mehrmals täglich in regelmäßigen oder unregelmäßigen Abständen oral 25 oder parenteral erfolgen. Aus Zweckmäßigkeitsgründen ist in dem meisten Fällen eine orale Verabreichung, insbesondere im Rhythmus der Nahrungs- und/oder Getränkeaufnahme der Tiere, vorzuziehen.

Die Wirkstoffe können als reine Stoffmischung oder in formulierter Form, 30 also in Mischung mit nichttoxischen inerten Trägerstoffen beliebiger Art, z.B. mit Trägerstoffen und in Formulierungen, wie sie bei nutritiven Zubereitungen üblich sind, verabreicht werden.

Die Wirkstoffe werden, gegebenenfalls in formulierter Form, zusammen mit 35 pharmazeutischen Wirkstoffen, Mineralsalzen, Spurenelementen, Vitaminen, Eiweiβstoffen, Fetten, Farbstoffen und/oder Geschmacksstoffen verabreicht. Empfehlenswert ist die orale Verabreichung zusammen mit dem Futter und/oder Trinkwasser, wobei je nach Bedarf der Wirkstoff der Gesamtmenge oder nur Teilen des Futters und/oder des Trinkwassers zugegeben wird.

40

Die Wirkstoffe werden nach üblichen Methoden durch einfaches Mischen als reine Stoffmischung, vorzugsweise in feinverteilter Form oder in formulierter Form in Mischung mit eßbaren nichttoxischen Trägerstoffen, gegebenenfalls in Form eines Praemixes oder eines Futterkonzentrates, dem Futter und/oder Trinkwasser beigefügt.

Die Art des Futters und seine Zusammensetzung ist ohne Belang. Es können alle gebräuchlichen oder speziellen Futterzusammensetzungenn verwendet werden, die vorzugsweise das übliche, für eine ausgewogene Ernährung notwendige Gleichgewicht aus Energie- und Aufbaustoffen einschließlich 5 Vitaminen und Mineralstoffen enthalten. Das Futter kann sich beispiels- weise zusammensetzen aus pflanzlichen Stoffen, z.B. Heu, Rüben, Getreide, Getreidenebenprodukten, tierischen Stoffen, z.B. Fleisch, Fetten, Knochenmehl, Fischprodukten, Vitaminen, z.B. Vitamin A, D-Komplex und B-Komplex, Proteinen, Aminosäuren, z.B. DL-Methionin und anorganischen Stoffen, z.B. 10 Kalk und Kochsalz.

Futterkonzentrate enthalten die Wirkstoffe neben eßbaren Stoffen, z.B. Roggenmehl, Maismehl, Sojabohnenmehl oder Kalk, gegebenenfalls mit weiteren Nähr- und Aufbaustoffen, sowie Proteinen, Mineralsalzen und 15 Vitaminen. Sie können nach den üblichen Mischmethoden hergestellt werden.

Vorzugsweise in Praemixen und Futterkonzentraten können die Wirkstoffe gegebenenfalls auch durch ihre Oberfläche bedeckende, geeignete Mittel, z.B. mit nichttoxischen Wachsen oder Gelatine vor Luft, Licht und/oder 20 Feuchtigkeit geschützt werden.

Die Erfindung wird in den nachfolgenden Beispielen weiter erläutert:

Beispiel 1 25 Beispiel für die Zusammensetzung eines Kükenaufzuchtfutters, dem ein erfindungsgemäßer Wirkstoff zugesetzt wird:

	Komponenten	Mais-Soja-Ration %	Gerste-Hafer-Tapioka-Ration %
	Mais	48,0	
30	Hafer	•	20,00
	Gerste	10,0	24, 49
	Tapioka		13,00
	Sojaschrot	31,0	31,00
	Sojaöl	3,0	5,00
35	Fischmehl	2,9	3,00
	Cefkaphos	1,76	1,76
	kohlens. Futterkalk	1,2	1, 20
	Viehsalz	0, 25	0, 25
	Spurenelement VM	0,025	0,025
40	Vitamin-VM	0,025	0,025
	Cholinchlorid	0,1	0, 10
	Methionin	0, 15	0,15
	Weizengrießkleie	1,59	
		100,00	100,00

Mant's corrigenative			
Mais-Soja-	Gerste-Hafer-Tapioka-		
Ration	Ration		
(Lufa Kiel)	(errechnet)		
21.8 %	21.6 %		

	•	Ration	Ration
		(Lufa Kiel)	(errechnet)
5	Rohprotein:	21,8 %	21,6 %
	Rohfett:	6,6 %	
	Rohfaser:	3,3 %	
	MJ ME:	12,4	12,3
	EZG:	82,5	
10	Ca:	1,1 %	1,02 %
	P:	0,84 %	0,88 %
	Na:	0,11 %	0,15 %
	Lysin:	1,22 %	0,51 %
	Methionin:	0,66 %	0,51 %

Beispiel 2

Beispiel für die Zusammesetzung eines Schweineaufzuchtfutters, dem ein erfindungsgemäßer Wirkstoff zugesetzt wird:

20

Zusammensetzung der Futtermischungen (g/kg)

	Ferkelaufzucht	Mastschweine
Mais	350	300
25 Gerste	153, 3	270
Tapioka	-	100
Hafer	_	100
Sojaschrot	120	150 ⁻
Fischmehl	-	40
0 Weizen	100	-
Magermilchpulver	100	-
Weizenkleie	80	4,65
Tierkörpermehl	40	_
Sojaöl	30	_
5 Cefkaphos	6,83	11
kohlens. Futterkalk	8, 0	14, 2
Viehsal z	2, 79	1,3
Spurenelement VM	0,8	0,6
Vitamin-VM	3,0	4,0
O Lysin	2,5	1,0 .
Methionin	1,0	2,0
Cholinchlorid	0,8	0, 25
Cr ₂ 0 ₃	1,0	1,0

Die angegebenen Futtergemische sind vorzugsweise zur Aufzucht und Mast von Küken bzw. Schweinen abgestimmt, sie können jedoch in gleicher oder ähnlicher Zusammensetzung auch zur Aufzucht und Mast anderer Tiere verwendet werden.

5

Mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen wurden mehrere Fütterungs- und Stoffwechseluntersuchungen durchgeführt.

Beispiel 3

10

Bewertung von Testverbindungen als Wachstumsförderer und körperfettreduzierende Substanzen in der Tierernährung - Rattentests

a) Tiercharakteristik und Futter

15

Ratten, männlich, SPF-Wistar (Fa. Thomae) 300 Tiere/Versuch (30 x 10) Gewicht bei Versuchsbeginn: 55 – 65 g

Contable had Veranishanda 105 220 m

Gewicht bei Versuchsende: 185 - 220 g

20

Futter: Haltungsdiät für Ratten mit folgender Zusammensetzung:

Gehalt

25 95 % Trockensubstanz

5 % Rohasche

13,8 % Rohprotein

5,3 % Rohfett

30 Rohnährstoffe und Vitamine

15,1 % Casein

10,0 % Zucker

3,0 % Cellulose

35

5,0 % Sojaöl

6,0 % Mineralstoff-VM

2,0 % Vitamin-VM

0.2 % Methionin

58,7 % Maisquellstärke

40 100 %

b) Behandlung der Tiere

Nach Ankunft der Tiere werden diese 3 Tage an die Versuchsbedingungen adaptiert und anschließend randomisiert.

Beispiel für eine Randomisierung

٠			Körpergewicht	
	Gruppe	Anzahl	Mittelwert	Standardabweichung
5	1	- 10	55,5	2,12
	2	10	55, 5	2, 27
	3	10	55,6	2, 22
	4	10	55,6	2, 27
	5	10	55,5	2, 27
10	6	10	55,5	2,17
	· 7	10	55,5	2,22
	8	10	55,6	2,27
	9	10	55,6	2,27
	10	10	55,5	2, 27
15	11	10	55, 5	2,07
	12	10	55,5	2,12
	13	10	55,5	2,07
	14	10	55,4	2,01
	15	10	55,5	2,17
20	16	10	55,6	2,17
	. 17	10	55,7	2, 21
	18	10	55,6	2,22
	19	10	55, 5	2,17
	20	10	55, 5	2,22
25	21	10	55,5	2,07
	22	10	55,4	2, 22
	23	10	55,6	2,17
	24	10	55,5	2,17
	25	10	55,5	2,07
30	26	10	55,5	2,17
•	27	10	. 5 5, 5	2,17
	28	10	55, 6	2,07
	29	. 10	55,6	1,96
-	30	10	55,4	2,06
35	Gesamt	300	55, 5	2,06

Die anschließende Testperiode beträgt 21 Tage. Die Tiere werden ad libitum und/oder rationiert (1. Woche 90 g; 2. Woche 110 g; 3. Woche 130 g) 40 gefüttert.

5,09

Die Tiere werden einzeln gehalten und in wöchentlichem Abstand gewogen.

Nach Versuchsende werden die Ratten mit ${\rm CO}_2$ getötet.

55,3

Deletiert

Zur Ganzkörperanalyse werden die Tiere einer Versuchsgruppe autoklaviert und anschließend mit einem Kutter homogenisiert.

c) Ergebnisse

Die erhaltenen Daten werden nachfolgend tabellarisch dargestellt.

Tabelle 1: Bewertung von Testverbindungen als Körperfettreduzierende Substanzen an Ratten bei rationierter Fütterung (Versuchsperiode = 21 Tage, 10 Tiere)

	0
	_
	=
	N
	٠.
	Ü
	S
	=
	Ø
	E
	E
	Ø
	'n
	3
	N
	£
	Θ
	2
	<u>۔</u>
	0
3	¥

Veränderung der Futterverwertung (=g Lebendmassezu- nahme/kg Futter)	000 #+#	000 ###
#	<u> </u>	<u>6 6 6</u>
Protein/Fett [g/g'	1,444 1,530 1,530	1, 522 1, 248 1, 299
Abweichung des Rohfettgehaltes vgl. zur Kontrolle [%]	- 7,6 - 14,0	- 16,1 + 02,1
Abweichung des Rohproteingehaltes vgl. zur Kontrolle [%]	0 00° +±++1	1 1 1 ලබන්
Dosierung im Futter [ppm]	CH ₃ 50	CH ₃
Substanz	CH SN CH	H H CH-N

Anmerkung: a) Verhältnis Protein/Fett der Kontrollgruppe beträgt 1,358

Tabelle 2: Bewertung von Testverbindungen als wachstumsfördernde Substanzen an Ratten bel ad libitum Fütterung (Versuchsperiode = 21 Tage, 10 Tiere)

ħj

Verbesserung der Futterverwertung (=g Lebendmassezunahme/kg Futter) [%] Zuwachs <u>%</u> Dosierung im Futter [bbm] Substanz

+ 4,1 + 6,1 ± 0

2,5 5,0

Patentansprüche

 Mittel zur Leistungssteigerung bei der Tierernähung von kaltblütigen und warmblütigen Tieren, enthaltend mindestens entweder ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel I,

in der A und B entweder jeweils für ein Wasserstoffatom stehen oder zusammen eine Bindung bilden,

10 D Sauerstoff oder Schwefel, die Gruppe =NCN oder die Gruppe =NE bedeutet, wobei E eine Phenyl-, Benzyl-, Pyridyl, C_1 - C_4 -Alkylgruppe oder gemeinsam mit R^1 die Gruppe -(CH₂) $_k$ N= bedeutet, wobei k die Zahl 2 oder 3 darstellt,

R¹, falls D ein Sauerstoffatom ist:

15

- a) ein Wasserstoffatom oder
- b) eine C₁-C₆-Alkylgruppe, die durch 1 bis 3-Fluor-, Chlor- oder Bromatome, eine Hydroxy-, eine C₁-C₃-Alkoxy-, eine C₂-C₄-Alkanoyloxy-, C₁-C₃-Alkylsulfonyloxy-, eine Aminocarbonyloxy-, eine Mono- oder Di-(C₁-C₃-Alkyl) aminocarbonyloxy-, eine Mercapto-, eine C₁-C₃-Alkyl-mercapto-, eine Phenylmercapto-, eine Pyridylmercapto-, Pyridazinylmercapto-, Pyrimidinylmercapto-, Pyrazinylmercapto- oder eine Triazinylmercaptogruppe, eine Cyano-, eine Carboxy-, eine (C₁-C₄-Alkoxy)carbonylgruppe, eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylreste, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxyreste und/oder 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome substituiert sein kann, oder eine Imidazolyl-gruppe, die durch 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen substituiert sein kann, oder

TO

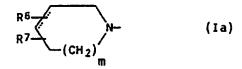
E5

20

25

30

eine Gruppe der Formel la

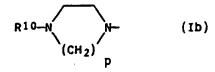


in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, R^6 ein Wasserstoffatom, eine C_1 - C_4 -Alkylgruppe, die gegebenenfalls durch einen Phenylrest substituiert ist, eine C_3 - C_6 - C_9 - C_1 - C_4 -Alkylgruppe, eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 C_1 - C_4 -Alkylgruppen, 1 oder 2 C_1 - C_4 -Alkoxygruppen oder 1 oder 2 Halogenatome und/oder durch eine Nitril-, Nitro- oder Trifluormethylgruppe substituiert sein kann, oder

eine Gruppe der Formel R^8R^9N - bedeutet, in der R^8 ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe ist, die 1- bis 2-fach durch Halogenatome, C_1-C_4 -Alkylreste, C_1-C_4 -Alkoxygruppen und/oder eine Nitril- und/oder Nitrogruppe substituiert sein kann, R^9 eine C_1-C_4 -Alkanoyl- oder Benzoylgruppe bedeutet oder R^8 und R^9 zusammen mit dem Stickstoffatom eine Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe bilden, R^7 dieselben Bedeutungen wie R^6 besitzen kann,

und m für 0, 1 oder 2 steht, oder

eine Gruppe der Formel Ib



worin R¹⁰ einen C₁-C₃-Kohlenwasserstoffrest, der durch einen Naphthylrest oder einen Phenylrest substituiert sein kann, wobei der Phenylrest gegebenenfalls 1 bis 2 Halogenatome, 1 bis 2 C₁-C₄-Alkylreste, 1 bis 2 C₁-C₄-Alkoxyreste oder eine Trifluormethyl-, Nitro-, Hydroxy-, C₁-C₄-Alkanyl-, (C₁-C₅-Alkoxy)-carbonyl- und/oder Cyanogruppe enthalten kann, einen Naphthylrest, einen Phenylrest, der 1- bis 3-fach durch Halogenatome, C₁-C₄-Alkylreste, C₁-C₄-Alkoxygruppen und/oder eine Trifluormethyl-oder eine C₁-C₄-Alkanoylgruppe substituiert sein kann, oder einen 6-gliedrigen Heteroarylrest mit 1 bis 2 Stickstoffatomen bedeutet und p die Zahl 2 oder 3 darstellt, oder

eine Gruppe der Formel Ic.

worin \mathbb{R}^{11} ein Wasserstoffatom, einen C_1 - C_8 -Alkylrest, der gegebenenfalls durch einen Phenylrest, der I bis 2 C_1 - C_4 -Alkylgruppen, 1 bis 2 C_1 - C_4 -Alkoxygruppen und/oder I bis 2 Halogenatome enthalten kann, substituiert ist, eine C_3 - C_1 2-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 3 Methylgruppen, einen Phenyl-oder Benzylrest substituiert sein kann, oder einen C_7 - C_1 0bi-oder tricyclischen Alkylrest, der durch 1 bis 3 Methylreste substituiert sein kann, oder eine benzokondensierte C_5 - C_7 -Cycloalkylgruppe bedeutet und \mathbb{R}^{12} ein Wasserstoffatom oder einen C_1 - C_8 -Alkylrest bedeutet, oder

eine Gruppe der Formel Id,

worin n die Zahl 1, 2 oder 3 bedeutet und der aromatische Ring durch 1 bis 2 Halogenatome, 1 bis 2 C₁-C₄-Alkylreste oder 1 bis 2 C₁-C₄-Alkoxyreste substituiert sein kann, oder

eine Gruppe der Formel Ie,

20

5

10

worin G für Sauerstoff- oder Schwefelatom steht und der heterocyclische Ring durch 1 bis 2 C_1 - C_4 -Alkylgruppen substituiert sein kann,

- 25 darstellt, oder
 - c) eine C_2 - C_6 -Alkenylgruppe bedeutet, die durch 1 Chloratom oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- 30 d) eine C3-C6-Alkinylgruppe darstellt oder
 - e) eine C3-C6-Cycloalkylgruppe darstellt, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkyl-gruppen und/oder 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome und/oder durch 1 Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

WO 89/10701 PCT/EP89/00477

- f) eine Phenylgruppe darstellt, die durch 1 bis 2 C_1 - C_3 -Alkylgruppen, 1 bis 2 C_1 - C_3 -Alkoxygruppen, 1 bis 2 Fluor-, Chlor-oder Bromatome, eine Aminogruppe, eine Mono- oder Di- C_1 - C_3 -Alkylaminogruppe, eine C_2 - C_4 -Alkanoylaminogruppe, eine Carboxygruppe oder eine C_1 - C_4 -Alkoxy-carbonylgruppe substituiert sein kann, oder
- g) eine Pyridyl, Pyridazinyl-, Pyrimidinyl-, Pyrazinyl- oder Triazinylgruppe darstellt, die durch 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen und/oder eine C₁-C₃-Alkoxygruppe, eine Hydroxygruppe, eine Aminogruppe, eine Monooder Di-C₁-C₃-Alkoxygruppe substituiert sein kann, oder

5

I5

20

- h) eine 5-gliedrige aromatische heterocyclische Gruppe darstellt, die als Heteroatome 1 Sauerstoff-, 1 Schwefel- und/oder 1, 2 oder 3 Stickstoffatome enthält und ggf. mit 1 bis 3 C_1 - C_3 -Alkylgruppen substituiert ist, oder
- i) eine C_1 - C_6 -Alkoxygruppe darstellt, die eine C_3 - C_6 -Cycloalkylgruppe, ein bis zwei Chlor- oder Bromatome, eine C_1 - C_3 -Alkoxygruppe oder eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C_1 - C_3 -Alkyl-, 1 bis 2 C_1 - C_3 -Alkoxy-, 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome, einen Trifluormethylrest oder eine Nitrogruppe substituiert sein kann, tragen kann, oder
- j) eine C3-C6-Alkenyloxygruppe darstellt, die durch eine Phenylgruppe substuiert sein kann, oder
- k) eine C₃-C₆-Alkinyloxygruppe darstellt, die durch einen Phenylrest substituiert sein kann, oder
- 1) eine C_3 - C_6 -Cycloalkyloxygruppe darstellt, die durch 1 bis 2 C_1 - C_3 Alkylgruppen und/oder 1 bis 2 Chlor- oder Bromatome substituiert sein kann, oder
- m) eine Phenoxygruppe darstellt, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylreste, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxygruppen, 1 bis 2 Fluor- oder Chloratome oder eine Nitrogruppe substituiert sein kann, oder
 - m) eine C₁-C₃-Alkylmercaptogruppe darstellt, oder
- o) die Gruppe $R^{13}R^{14}N$ darstellt, wobei R^{13} für ein Wasserstoffatom, eine $C_1-C_3-Alkyl-$, eine $C_3-C_4-Alkenyl-$ oder eine $C_3-C_4-Alkinylgruppe$ oder eine Phenylgruppe steht und R^{14} ein Wasserstoffatom oder eine $C_1-C_3-Alkylgruppe$ bedeutet, oder

 R^1 , falls D ein Schwefelatom darstellt, eine C_1 - C_4 -Alkylaminogruppe oder eine Di- $(C_1$ - C_4 -Alkyl)aminogruppe bedeutet, oder

 R^1 , falls D die Gruppe =N-CN darstellt, für ein Wasserstoffatom, eine 5 C_1 - C_4 -Alkylgruppe, eine Phenylgruppe, eine C_1 - C_4 -Alkylamino- oder eine Di $(C_1$ - C_4 -Alkyl)aminogruppe steht, oder

 R^1 , falls D die Gruppe =NE darstellt, ein Wasserstoffatom, eine $C_1-C_4-Alkylgruppe$, eine Phenylgruppe, eine Pyridinylgruppe, eine 10 $C_1-C_4-Alkinylamino-$ oder eine Di- $(C_1-C_4-Alkyl)$ -aminogruppe bedeutet,

 R^2 ein Wasserstoffatom oder eine C_{1-3} -Alkylgruppe darstellt,

oder R^1 und R^2 gemeinsam eine C_2 - C_4 -Alkylidengruppe bilden, die durch 1 15 bis 2 C_{1-3} -Alkylgruppen und/oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann,

R3 und R4 unabhängig voneinander stehen für

a) ein Wasserstoffatom oder

20

35

b) eine C₁-C₆-Alkylgruppe, die durch 1 bis 3-Fluor-, Chlor- oder Bromatome, eine Hydroxy-, eine C₁-C₃-Alkoxy, eine C₂-C₄-Alkanoyloxy-, eine C₁-C₃-Alkylsulfonyloxy-, eine Aminocarbonyloxy-, eine Mono- oder Di-(C₁-C₃-Alkyl)aminocarbonyloxy-, eine Mercapto-, eine C₁-C₃-Alkylmercapto-, eine Phenylmercapto-, eine Pyridylmercapto-, Pyridazinylmercapto-, Pyrimidinylmercapto-, Pyrazinylmercapto- oder eine Triazinylmercaptogruppe, eine Cyano-, eine Carboxy-, eine (C₁-C₄-Alkoxy)carbonylgruppe, eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylreste, 1 bis 2 C₁-C₃-Alkoxyreste und/oder 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome substituiert sein kann, oder eine Imidazolyl-

Chlor- oder Bromatome substituiert sein kann, oder eine Imidazolyl- gruppe, die durch 1 bis 3 C_1 - C_3 -Alkylgruppen substituiert sein kann, oder

eine Gruppe der Formel If,

in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, R^6 ein Wasserstoffatom, eine C_1 - C_4 -Alkylgruppe, die gegebenenfalls durch einen Phenylrest substituiert ist, eine C_3 - C_6 - C_9 cloalkylgruppe,

eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 C_1C_4 -Alkylgruppen, 1 oder 2 C_1C_4 -Alkoxygruppen oder 1 oder 2 Halogenatome und/oder durch eine Nitril-, Nitro- oder Trifluormethylgruppe substituiert sein kann, oder

eine Gruppe der Formel R^8R^9N - bedeutet, in der R^8 ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe ist, die 1- bis 2-fach durch Halogenatome, C_1 - C_4 -Alkylreste, C_1 - C_4 -Alkoxygruppen und/oder eine Nitril- und/oder Nitrogruppe substituiert sein kann, R^9 eine C_1 - C_4 -Alkanoyl oder eine Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe darstellt, R^7 dieselben Bedeutungen wie R^6 besitzen kann,

und m für 0, 1 oder 2 steht oder

eine Gruppe der Formel Ig,

WO 89/10701

5

10

15

20

25

30

35

worin R^{10} einen C_1 - C_3 -Kohlenwasserstoffrest, der durch einen Naphthylrest oder einen Phenylrest substituiert sein kann, wobei der Phenylrest gegebenenfalls 1 bis 2 Halogenatome, 1 bis 2 C_1 - C_4 -Alkylreste, 1 bis 2 C_1 - C_4 -Alkoxyreste oder eine Trifluormethyl-, Nitro-, Hydroxy-, C_1 - C_4 -Alkanyl-, $(C_1$ - C_5 -Alkoxy)-carbonyl- und/oder Cyangruppe enthalten kann, einen Naphthylrest, einen Phenylrest, der 1- bis 3-fach durch Halogenatome, C_1 - C_4 -Alkylreste, C_1 - C_4 -Alkoxygruppen und/oder eine Trifluormethyl-oder eine C_1 - C_4 -Alkanoylgruppe substituiert sein kann, oder einen 6-gliedrigen Heteroarylrest mit 1 bis 2 Stickstoffatomen bedeutet und p die Zahl 2 oder 3 darstellt, oder

eine Gruppe der Formel Ih,

worin R^{11} ein Wasserstoffatom, einen C_1 - C_8 -Alkylrest, der gegebenenfalls durch einen Phenylrest, der 1 bis 2 C_1 - C_4 -Alkylgruppen, 1 bis 2 C_1 - C_4 -Alkoxygruppen und/oder 1 bis 2 Halogenatome enthalten kann, substituiert ist, eine C_3 - C_1 2-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 3 Methylgruppen, einen Phenyl-oder Benzylrest substituiert sein kann,

oder einen C7-C $_{10}$ bi-oder tricyclischen Alkylrest, der durch 1 bis 3 Methylreste substituiert sein kann, oder eine benzokondensierte C $_{5}$ -C $_{7}$ -Cycloalkylgruppe bedeutet und R 12 ein Wasserstoffatom oder einen C $_{1}$ -C $_{8}$ -Alkylrest bedeutet, oder

5

- c) eine C2-C6-Alkenylgruppe, die durch 1 Chloratom oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- d) eine C3-C6-Alkinylgruppe oder

10

- e) eine C_3 - C_6 -Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 2 C_1 - C_3 -Alkylgruppen und/oder 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome und/oder durch 1 Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- I5 f) eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C_1 - C_3 -Alkylgruppen, 1 bis 2 C_1 - C_3 -Alkoxygruppen, 1 bis 2 Fluor-, Chlor-oder Bromatome, eine Aminogruppe, eine Mono- oder Di- C_1 - C_3 -Alkylaminogruppe, eine C_2 - C_4 -Alkanoylaminogruppe, eine Carboxygruppe oder eine C_1 - C_4 -Alkoxy-carbonylgruppe substituiert sein kann, oder

20

g) eine Pyridyl, Pyridazinyl-, Pyrimidinyl-, Pyrazinyl- oder Triazinyl-gruppe, die durch I bis 3 C_1 - C_3 -Alkylgruppen und/oder eine C_1 - C_3 -Alkoxygruppe, eine Hydroxygruppe, eine Aminogruppe, eine Mono- oder Di- C_1 - C_3 -Alkoxygruppe substituiert sein kann, oder

25

h) eine 5-gliedrige aromatische heterocyclische Gruppe, die als Heteroatome 1 Sauerstoff-, 1 Schwefel- und/oder 1, 2 oder 3 Stickstoffatome enthält und ggf. mit 1 bis 3 C₁-C₃-Alkylgruppen substituiert ist, oder

30 i) eine C_1 - C_6 -Alkoxygruppe, die eine C_3 - C_6 -Cycloalkylgruppe, ein bis zwei Chlor- oder Bromatome, eine C_1 - C_3 -Alkoxygruppe oder eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 C_1 - C_3 -Alkyl-, 1 bis 2 C_1 - C_3 -Alkoxy-, 1 bis 2 Fluor-, Chlor- oder Bromatome, einen Trifluormethylrest oder eine Nitrogruppe substituiert sein kann, tragen kann, oder

- j) eine C3-C6-Alkenyloxygruppe, die durch eine Phenylgruppe substuiert sein kann, oder
- k) eine C3-C6-Alkinyloxygruppe, die durch einen Phenylrest substituiert
 sein kann, oder

- eine C₃-C₆-Cycloalkyloxygruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylgruppen und/oder 1 bis 2 Chlor- oder Bromatome substituiert sein kann, oder
- m) eine Phenoxygruppe, die durch 1 bis 2 C₁-C₃-Alkylreste, 1 bis 2
 5 C₁-C₃-Alkoxygruppen, 1 bis 2 Fluor- oder Chloratome oder eine Nitrogruppe substituiert sein kann, oder
 - n) eine C1-C3-Alkylmercaptogruppe, oder
- 10 o) die Gruppe $R^{13}R^{14}N$, wobei R^{13} für ein Wasserstoffatom, eine C_1 - C_3 -Alkyl-, eine C_3 - C_4 -Alkenyl- oder eine C_3 - C_4 -Alkinylgruppe oder eine Phenylgruppe steht und R^{14} ein Wasserstoffatom oder eine C_1 - C_3 -Alkyl-gruppe bedeutet; und

15 R⁵

- a) ein Wasserstoffatom
- b) eine C_1 - C_6 -Alkylgruppe, die durch 1-3 Fluor-, Chlor- oder Bromatome, eine Hydroxy-, eine Cyano- oder Carboxygruppe substituiert sein kann,
 - c) ein Halogenatom, oder
- d) eine Cyano-, Carboxy-, Nitro-, Nitroso-, Hydroxy- oder Aminogruppe,
 die durch ein oder zwei C₁-C₆-Alkylreste mit gegebenenfalls einem Halogenatom oder einer Hydroxygruppe substituiert sein kann,

darstellt;

30 oder ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel II

in der A, B, D, \mathbb{R}^3 , \mathbb{R}^4 und \mathbb{R}^5 die für Formel I angegebenen Bedeutungen besitzen,

15

20

25

30

35

 R^{15} ein Wasserstoffatom, einen C_{1-4} -Alkylrest, eine Phenyl-, eine Hydroxy-, eine C_{1-4} -Alkoxy-, eine Phenoxygruppe, die Gruppe R^{18} -NH-CH2-CH(OH)-CH2O-, in der R^{18} die Isopropyl- oder tert.-Butyl-gruppe bedeutet, eine Nitro-, Trifluormethyl-, Carboxy-, C_{1} -C4-Alkoxy-carbonyl-, Aminocarbonyl- oder Cyanogruppe, ein Fluor-, Chlor- oder Bromatom, eine Amino-, C_{1-4} -Alkylamino-, oder Di(C_{1} -C4-Alkyl)-amino-gruppe, einen Pyrrolidin-, Piperidin- oder Morpholinrest, oder die Gruppe -NH-CH2-J, wobei J einen Pyridyl-, Furyl-, Thienyl- oder Phenylrest bedeutet, wobei der Phenylrest durch 1 bis 3 Reste aus der Gruppe Halogen, Hydroxy, C_{1} -C4-Alkoxy)carbonyl oder C_{1} -C4-Alkyl substituiert sein kann,

oder eine Gruppe -NHL, worin L eine 5- oder 6-gliedrige heterocyclische Gruppe, die 1 N-, 0- oder S-Atom und gegebenenfalls 1 bis 2 weitere N-Atome besitzt, bedeutet, wobei die heterocyclische Gruppe durch einen Rest aus der Gruppe Cyano, Hydroxy, C_1 - C_4 -Alkoxy, Amino, C_1 - C_4 -Alkylamino, Di- $(C_1$ - C_4 -Alkyl)amino, $(C_1$ - C_4 -Alkoxy)carbonyl, Aminocarbonyl oder C_1 - C_4 -Alkanoyl oder durch 1 bis 3 C_1 - C_4 -Alkyl-gruppen, wobei eine dieser C_1 - C_4 -Alkylgruppen durch eine Hydroxygruppe oder den Rest $R^{19}R^{20}N$ substituiert sein kann, wobei R^{19} und R^{20} unabhängig voneinander Wasserstoffatome, C_1 - C_4 -Alkylreste, Benzyl-oder Phenethylgruppen bedeuten oder die Gruppe $R^{19}R^{20}N$ für eine Pyrrolidin-, Piperidin- oder Morpholinrest steht, substituiert sein kann;

oder ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel III

$$\begin{array}{c}
R^{19} \\
R^{20}
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
R^{5} \\
R \\
R^{21}
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
R^{5} \\
R^{3}
\end{array}$$
(III)

în der ${\sf R^3}$, ${\sf R^4}$ und ${\sf R^5}$, A und B die für Formel I angegebenen Bedeutungen besitzen,

X und Y unabhängig voneinander ein N-Atom oder ein Kohlenstoffatom, das durch ein Wasserstoffatom oder einen der Reste R^{19} , R^{20} oder R^{21} substituiert ist, bedeuten, wobei

 R^{19} ein Wasserstoffatom, eine C_1 - C_4 -Alkylgruppe, eine C_1 - C_4 -Hydroxy-alkylgruppe, eine C_1 - C_4 -Alkanoyl-, eine Hydroxycarbonyl, eine $(C_1$ - C_4 -Alkoxy)carbonyl-, eine Aminocarbonyl-, eine Cyanogruppe

oder eine Gruppe der Formel IIIa

bedeutet, wobei

 $\begin{array}{lll} & & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ &$

 R^{23} ein Wasserstoffatom oder eine $C_1\text{--}C_6\text{--Alkylgruppe}$ bedeutet, oder

10

R²² und R²³ gemeinsam mit dem N-Atom, an das sie gebunden sind, einen Pyrrolidin-, Piperidin- oder Piperazinrest bedeuten, der durch eine Phenylgruppe und/oder eine Hydroxygruppe substituiert sein kann,

15 R^{24} eine C_1 - C_4 -Alkylidengruppe bedeutet, und

 R^{20} und R^{21} unabhängig voneinander Wasserstoffatome oder $C_1 - C_4 - Alkylgruppen$ bedeuten,

oder die physiologisch verträglichen Salze der Verbindungen der allgemeinen Formel I, II und III.

2. Mittel nach Anspruch 1, enthaltend mindestens ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel I

25

$$\begin{array}{c|c}
R^5 & D \\
R^7 & R^4 \\
R^1 & R^2 & R^3
\end{array} (1)$$

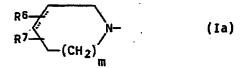
in der

A und B entweder jeweils ein Wasserstoffatom bedeuten oder zusammen eine Bindung bilden,

30 D ein Sauerstoffatom bedeutet,

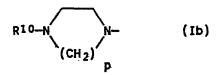
R¹ die folgende Bedeutung besitzt:

- a) ein Wasserstoffatom oder
- 5 b) eine C₁-C₃-Alkylgruppe, die durch ein Chloratom, eine Hydroxy-, eine Methoxy-, eine Acetoxy-, eine Methylmercapto-, eine Pyridiylmercapto-, eine Cyano-, eine Carboxy-, eine (C₁₋₄-Alkoxy)-carbonyl- oder eine Phenylgruppe oder eine Gruppe der Formel Ia,



- in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, und R⁶ ein Wasserstoffatom, eine Methylgruppe ist, eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch I oder 2 Methyl-, Methoxygruppen oder Chloratome substituiert sein kann, oder eine Gruppe der Formel R⁸R⁹N bedeutet, in der R⁸ ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe und R⁹ eine Propionyl- oder Benzoylgruppe bedeutet oder R⁸ und R⁹ zusammen mit dem Stickstoffatom eine Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe bilden, R⁷ ein Wasserstoffatom, eine Methyl, eine Hydroxy-, eine Acetyl-, eine Ethoxycarbonyl oder eine Cyanogruppe bedeutet,
- 20 m für 1 steht, oder

eine Gruppe der Formel Ib



worin R¹⁰ einem Benzyl-, einem Naphthyl- oder einem Phenylrest, der 1-25 bis 3-fach durch Chloratome, Methyl- und/oder Methoxygruppem substituiert sein kann, oder einem Pyridylrest bedeutet und

p die Zahl 2 bedeutet, oder

eine Gruppe der Formel Ic,

worin R^{11} einen $\mathsf{C}_1\text{-}\mathsf{C}_3\text{-}\mathsf{Alkylrest},$ der gegebenenfalls durch einen Phenylrest substituiert ist, und R^{12} ein Wasserstoffatom oder einen Methylrest bedeuten, oder

eine Gruppe der Formel Id,

worin n die Zahl 2 bedeutet, oder

10

5

eine Gruppe der Formel Ie,

worin G für ein Wasserstoffatom steht und der heterocyclische Ring durch 1 bis 2 C_1 - C_4 -Alkylgruppen substituiert sein kann, oder

15

- c) eine $C_2-C_4-Alkenylgruppe$, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- d) eine C3-C4-Alkinylgruppe oder

- e) eine C3-C6-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen und/oder 1 bis 2 Chloratome und/oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- 25 f) eine Phenylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen, 1 bis 2 Methoxygruppen, 1 bis 2 Chloratome, eine Carboxygruppe oder eine Ethoxycarbonylgruppe substiuiert sein kann, oder

- g) eine Pyridylgruppe, die durch 1 bis 3 Methylgruppen substituiert sein kann, oder
- h) eine Thiophenyl-, Furanyl-, Imidazolyl- oder Oxazolylgruppe, die
 5 gegebenenfalls mit 1 bis 3 Methylgruppen substituiert ist, oder
 - i) eine C_1 - C_4 -Alkoxygruppe, die durch eine Methoxygruppe oder durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- 10 j) eine C3-C4-Alkenyloxygruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
 - k) eine C₃-C₄-Alkinyloxygruppe, die durch einen Phenylrest substituiert sein kann, oder

- 1) eine C3-C6-Cycloalkoxygruppe oder
- m) eine Phenoxygruppe oder
- 20 n) eine Methylmercaptogruppe oder
 - o) die Gruppe $R^{13}R^{14}N^{-}$, wobei R^{13} für ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, eine Allyl- oder eine Propionylgruppe steht und R^{14} ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe bedeutet,

25
R² ein Wasserstoffatom bedeutet

oder \mathbb{R}^1 und \mathbb{R}^2 gemeinsam eine \mathbb{C}_2 - \mathbb{C}_4 -Alkylidengruppe bilden, die durch 1 bis 2 Methylgruppen substituiert sein kann,

30

 ${\bf R^3}$ und ${\bf R^4}$ unabhängig voneinander stehen für

- a) ein Wasserstoffatom oder
- 35 b) eine C_1 - C_3 -Alkylgruppe, die durch ein Chloratom, eine Hydroxy-, eine Methoxy-, eine Acetoxy-, eine Methylmercapto-, eine Pyridiylmercapto-, eine Cyano-, eine Carboxy-, eine $(C_{1-4}$ -Alkoxy)-carbonyl- oder eine Phenylgruppe oder eine Gruppe der Formel If,

$$R^6$$
 $(CH_2)_m$
(If)

in der die gestrichelte Linie eine zusätzliche Bindung bedeuten kann, und R^6 ein Wasserstoffatom, eine Methylgruppe ist, eine Phenylgruppe, die gegebenenfalls durch 1 oder 2 Methyl-, Methoxygruppen oder Chloratome substituiert sein kann, oder eine Gruppe der Formel R^8R^9N bedeutet, in der R^8 ein Wasserstoffatom oder eine Phenylgruppe und R^9 eine Propionyl- oder Benzoylgruppe bedeutet oder R^8 und R^9 zusammen mit dem Stickstoffatom eine Benzimidazol-2-on-1-yl-Gruppe bilden, R^7 ein Wasserstoffatom, eine Methyl, eine Hydroxy-, eine Acetyl-, eine Ethoxycarbonyl oder eine Cyanogruppe bedeutet,

10

m für 1 steht oder

eine Gruppe der Formel Ig,

$$R^{10-N}$$
 (CH_2)
 p

worin R¹⁰ einen Benzyl-, einen Naphthyl- oder einen Phenylrest, der 1bis 3-fach durch Chloratome, Methyl- und/oder Methoxygruppen substituiert sein kann, oder einen Pyridylrest bedeutet und

p die Zahl 2 bedeutet, oder

20

25

eine Gruppe der Formel Ih

worin R^{11} einen C_1 - C_3 -Alkylrest, der gegebenenfalls durch einen Phenylrest substituiert ist, und R^{12} ein Wasserstoffatom oder einen Methylrest bedeuten, oder

- c) eine C₂-C₄-Alkenylgruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- 30 d) eine C₃-C₄-Alkinylgruppe oder

- e) eine C₃-C₆-Cycloalkylgruppe, die durch 1 bis 2 Methylgruppen und/oder 1 bis 2 Chloratome und/oder eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
- 5 f) eine Phenylgruppe, die durch I bis 2 Methylgruppen, 1 bis 2 Methoxygruppen, 1 bis 2 Chloratome, eine Carboxygruppe oder eine Ethoxycarbonylgruppe substiuiert sein kann, oder
- g) eine Pyridylgruppe, die durch 1 bis 3 Methylgruppen substituiert sein 10 kann, oder
 - h) eine Thiophenyl-, Furanyl-, Imidazolyl- oder Oxazolylgruppe, die gegebenenfalls mit 1 bis 3 Methylgruppen substituiert ist, oder
- 15 i) eine C_1 - C_4 -Alkoxygruppe, die durch eine Methoxygruppe oder durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder
 - j) eine C_3 - C_4 -Alkenyloxygruppe, die durch eine Phenylgruppe substituiert sein kann, oder

- k) eine C₃-C₄-Alkinyloxygruppe, die durch einen Phenylrest substituiert sein kann, oder
- eine C₃-C₆-Cycloalkoxygruppe oder

25

- m) eine Phenoxygruppe oder
- n) eine Methylmercaptogruppe oder
- 30 o) die Gruppe $R^{13}R^{14}N^{-}$, wobei R^{13} für ein Wasserstoffatom, eine Methyl-, eine Allyl- oder eine Propionylgruppe steht und R^{14} ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe bedeutet; und

R5

- a) ein Wasserstoffatom
- b) eine C_1 - C_3 -Alkylgruppe, die endständig durch ein Fluor-, Chlor-oder Bromatom, eine Hydroxy-, eine Cyano- oder Carboxygruppe substituiert sein kann,
 - c) ein Brom- oder Chloratom, oder

- d) eine Cyano-, Carboxy-, Nitro-, Nitroso-, Hydroxy- oder Aminogruppe, die durch ein oder zwei C_1 - C_3 mit gegebenenfalls endständigen Chloratom oder einer Hydroxygruppe substituiert sein kann,
- 5 darstellt;

oder ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel II

in der

10

A, B, D, \mathbb{R}^3 , \mathbb{R}^4 und \mathbb{R}^5 die in diesem Anspruch für die Formel I angegebenen Bedeutungen besitzen; und

15۾

15

- a) ein Wasserstoffatom
- b) einen C₁-C₄-Alkylrest,
- 20 c) eine Cyano-, Carboxy- oder Aminogruppe, die durch gegebenenfalls ein bis zwei C_1 - C_3 -Alkylgruppen substituiert sein kann
 - d) einen Piperidinrest
- 25 e) die Gruppe NHCH2J, wobei J ein Pyridyl-, Furyl-, Thionyl- oder Phenylrest bedeutet,
- f) die Gruppe NHL, worin L einen Pyridyl- oder einen Thiazolylrest bedeutet, wobei der Pyridyl- oder der Thiazolylrest durch 1-2
 Methylgruppen substituiert sein kann,

darstellt;

oder ein Uracil-Derivat der allgemeinen Formel III

in der

5 A, B, D, R³, R⁴ und R⁵ die in diesem Anspruch für die Formel I angegebenen Bedeutungen besitzen; und

der Rest

20

25

insgesamt für einen der folgenden Reste steht: einen Imidazol-1-yl-rest, der durch 1-3 Methylgruppen oder eine Hydroxymethylgruppe substituiert sein kann,

oder einen 1,2,4-Triazol-1-yl-rest, einen Pyrazol-1-yl-rest, oder einen Pyrrol-1-yl-rest, der durch eine Hydroxymethylgruppe, eine Formylgruppe, eine Acetylgruppe oder eine Gruppe der Formel IIIa,

substituiert ist, in der R²² eine C₁-C₃-Alkyl-, eine Benzyl-, eine C₁-C₄-Alkanoyl oder eine Benzoylgruppe bedeutet, R²³ ein Wasserstoff- atom oder eine C₁-C₆-Alkylgruppe bedeutet, oder R²² und R²³ gemeinsam mit dem N-Atom einen Piperidin- oder Piperazinrest darstellen, der durch eine Phenylgruppe substituiert ist, und

R²⁴ eine C₁-C₃-Alkylidengruppe bedeutet;

oder die physiologisch verträglichen Salze der Verbindungen der allgemeinen Formeln I, II und III.

- 3. Mittel nach einem der Ansprüche 1 oder 2 in Form von Tierfutter, Trinkwasser für Tiere, Zusatz für Tierfutter und Trinkwasser oder in Form eines Praemixes.
- 5 4. Verwendung der Uracil-Derivate der allgemeinen Formeln I, II und III gemäß einem der Ansprüche 1 bis 2 zur Leistungssteigerung bei der Tierzucht, insbesondere zur Wachstumsförderung, Verbesserung der Futterverwertung, Erhöhung des Proteinanteils und/oder Verringerung des Fettgehalts bei Tieren.

2

15

20

25

30

35

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application NoPCT/EP 89/00477

		Internation Application (10 PC-I.)	EP 89/004//		
	SSIFICATION OF SUBJECT MATTER (if several c				
	ng to international Patent Classification (IPC) or to both				
Int.	.Cl A 23 K 1/16	<u> </u>	•		
(I. FIEL	DS SEARCHED				
<u> </u>		umentation Searched ?			
Classifica	tion System	Classification Symbols			
Int.	A 23 K, C 07	D .			
		her than Minimum Documentation ents are included in the Fields Searched ⁸			
III. DOC	UMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT				
Category *	Citetion of Document, 11 with Indication, where	appropriate, of the relevant passages 12	Relevant to Claim No. 13		
x	US, A, 2328355 (J.J. OLE see page 1, left han 1-6,21-27,39-44; exaleft hand column, lines 1	d column, lines mples 1,2; page 2, nes 29-41, right	1-4		
X	see claims, 1,6,8,9;	A, 1436283 (DIAMALT) 19 May 1976 see claims, 1,6,8,9; page 1, lines 9-16, 51 - page 2, line 96; examples 1-3			
x	US, A, 4239888 (M.W. MILE see column 2, lines a line 44 - column 9, lines 50-54	4-22; column 3,	1-4		
X	EP, A, 0107161 (CTA FINAN see page 1, line 9 - page 3, line 31 - page page 5, lines 15-20,3 examples 1-3	page 2, line 7; ge 4, line 27;	1-4		
"A" doc con "E" earl filln "L" doc which cite "O" doc othe "P" doc late	al categories of cited documents: 10 cument defining the general state of the art which is no isidered to be of particular relevance lier document but published on or after the internationa g date cument which may throw doubts on priority claim(s) or ch is cited to establish the publication date of another tion or other special reason (as specified) cument referring to an oral disclosure, use, exhibition or means ument published prior to the international filling date but r than the priority date claimed IFICATION Actual Completion of the international Search	"X" document of particular relevance cannot be considered novel or of involve an inventive step "Y" document of particular relevance cannot be considered to involve at document is combined with one of ments, such combination being of the pt	twith the application but or theory underlying the state of the claimed invention cannot be considered to the claimed invention in the claimed invention in more other such docupious to a person skilled atent family		
	•				
та дл	ily 1989 (18.07.89)	8 August 1989 (08.	U8.89)		
	al Searching Authority EAN PATENT OFFICE	Signature of Authorized Officer			

		CONSIDERED TO BE RELEVANT (CONTINUED FROM THE BECOND SHEET	·
Category *		Station of Document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to Claim No
x	US, I	1,3,4	
x		A, 2438353 (C.W. TURNER et al.) 23 March 1948, see column 1 - line 1 - column 3, line 6; examples I-VI	1,3,4
X	DE,	1-4	
			•
•			
		•	
		į	
	•		
			·
		·	

ANNEX TO THE INTERNATIONAL SEARCH REPORT ON INTERNATIONAL PATENT APPLICATION NO.

EP 8900477 SA 28234

This annex lists the patent family members relating to the patent documents cited in the above-mentioned international search report. The members are as contained in the European Patent Office EDP file on 03/08/89

The European Patent Office is in no way liable for these particulars which are merely given for the purpose of information.

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US-A- 2328355		None .	
GB-A- 1436283	19-05-76	None	
US-A- 4239888	16-12-80	None	
EP-A- 0107161	02-05-84	CH-B- 650906 CA-A- 1222953 JP-A- 59130221	30-08-85 16-06-87 26-07-84
US-A- 2456515		None	
US-A- 2438353		None	
DE-A- 1767274	18-05-72	AT-A- 290970 BE-A- 713857 CH-A- 505560 FR-A- 1569124 GB-A- 1193191 LU-A- 55923 NL-A- 6805419 US-A- 3627892	15-05-71 18-10-68 15-04-71 30-05-69 28-05-70 30-07-68 21-10-68 14-12-71

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 89/00477

				E 03/004//
1		N DES ANMELDUNGSGEGENSTANDS (bei r		nzugeben) [©]
1	der Internati A 23 K	onalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der 1/16	nationalen Klassifikation und der IPC	
L				
II. REC	HERCHIERT	E SACHGEBIETE		
		Recherchlerter M		
Klassifik	ationssystem		Klassifikationssymbole	
int. Ci.4		A 23 K, C 07 D		
		Recherchierte nicht zum Mindestprüfstoff g unter die recherchierte	a • ·	
		, ·	•	
IILEINS	CHLÄGIGE	VERÖFFENTLICHUNGEN ⁹		
Art*	Kennzeich	nung der Veröffentlichung ¹¹ ,soweit erforderlich	n unter Angabe der maßgeblichen Teile 12	Betr. Anspruch Nr. 13
Х	3 5 1 S	, 2328355 (J.J. OLESON) 1. August 1943 iehe Seite 1, linke Spal -6,21-27,39-44; Beispiel eite 2, linke Spalte, Ze echte Spalte, Zeilen 12-	le 1,2;	1-4
X.	1: s:	, 1436283 (DIAMALT) 9. Mai 1976 iehe Ansprüche 1,6,8,9; -16,51 - Seite 2, Zeile		1-4
x	10 S: Ze	, 4239888 (M.W. MILLER) 6. Dezember 1980 iehe Spalte 2, Zeilen 4- eile 44 - Spalte 9, Zeil eilen 50-54		1-4
"E" älte	offentlichung, iniert, aber ni res Dokument alen Anmelde	cht als besonders bedeutsam anzusahen ist t, das jedoch erst am oder nach dem Interna- datum veröffentlicht worden ist	"T" Spätere Veröffentlichung, die nach de meldedatum oder dem Prioritätsdatum ist und mit der Anmeldung nicht klub Verständnis das der Erfindung zugru oder der ihr zugrundellegenden Theorie	veröffentlicht worden diert, sondern nur zum Indeliegenden Prinzips
zwe fent nam	rifelhaft erschi dichungsdatun nten Veröffent	einen zu lassen, oder durch die das veror- n einer anderen im Recherchenbericht ge- lichung belegt werden soll oder die aus einem	"X" Veröffentlichung von besonderer Beder te Erfindung kann nicht als neu oder at keit beruhend betrachtet werden "Y" Veröffentlichung von besonderer Beder "Y" veröffentlichung von besonderer Beder	uf erfinderischer Tätig- utung; die beenspruch-
eine bezi	Benutzung, ieht	die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen die vor dem internationalen Anmeldeda-	te Erfindung kann nicht als auf erfin ruhend betrachtet werden, wenn die einer oder mehreren anderen Veröffent gorie in Verbindung gebracht wird und einen Fachmann naheliegend ist	Veröffentlichung mit Ilchungen dieser Kate-
turn	, aber nach de t worden ist	t	"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselber	n Patentfamilie ist
	HEINIGUNG			
Datur	n des Abschlu	sses der internationalen Recherche	Absendedatum des Internationalen Recherc	chenberichts
18.	Juli 19	89	0 8 AUG 1989	
Intern	nationale Rech	erchenbehörde	Unterschrift des bevollmächtigten Bedienst	eten
		iuses Black on Britania	M. VAN MOL	

III.EINS	CHLÄGIGE VERÖFFENTLICHUNGEN (Fortsetzung von Blatt 2)	EP 89/00477
Art *	Kennzeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der maßgeblichen Teile	Betr. Anspruch Nr.
x	EP, A, 0107161 (CTA FINANZ AG) 2. Mai 1984 siehe Seite 1, Zeile 9 - Seite 2, Zeile 7; Seite 3, Zeile 31 - Seite 4, Zeile 27; Seite 5, Zeilen 15-20,30 - Seite 6, Zeile 2; Beispiele 1-3	1-4
x	US, A, 2456515 (J. KAMLET et al.) 14. Dezember 1948 siehe Spalte 1, Zeilen 1-29; Spalte 2, Zeile 3 - Spalte 4, Zeile 43; Ansprüche 1,2	1,3,4
x	US, A, 2438353 (C.W. TURNER et al.) 23. März 1948 siehe Spalte 1, Zeile 1 - Spalte 3, Zeile 6; Beispiele I-VI	1,3,4
х	DE, A, 1767274 (CHEMOFORMA) 18. Mai 1972 siehe Ansprüche 1,11-16,19,22,26,27, 32,34,36; Beispiele 1-5	1-4
	•	
		·
		ľ

ANHANG ZUM INTERNATIONALEN RECHERCHENBERICHT ÜBER DIE INTERNATIONALE PATENTANMELDUNG NR.

EP 8900477

SA 28234

In diesem Anhang sind die Mitglieder der Patentfamilien der im obengenannten internationalen Recherchenbericht angeführten Patentdokumente angegeben.
Die Angaben über die Familienmitglieder entsprechen dem Stand der Datei des Europäischen Patentamts am 03/08/89

Diese Angaben dienen nur zur Unterrichtung und erfolgen ohne Gewähr.

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie Ke 1 ne		Datum der Veröffentlichung
US-A- 2328355				
GB-A- 1436283	19-05-76	Keine		
US-A- 4239888	16-12-80	Keine		
EP-A- 0107161	02-05-84	CH-B- CA-A- JP-A-	650906 1222953 59130221	30-08-85 16-06-87 26-07-84
US-A- 2456515		Keine		
US-A- 2438353		Keine		
DE-A- 1767274	18-05 - 72	AT-A- BE-A- CH-A- FR-A- GB-A- LU-A- NL-A- US-A-	290970 713857 505560 1569124 1193191 55923 6805419 3627892	15-05-71 18-10-68 15-04-71 30-05-69 28-05-70 30-07-68 21-10-68 14-12-71

BLANK PAGE